

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成21年6月18日(2009.6.18)

【公表番号】特表2008-540367(P2008-540367A)

【公表日】平成20年11月20日(2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2008-046

【出願番号】特願2008-509409(P2008-509409)

【国際特許分類】

C 07 D 451/10 (2006.01)

A 61 K 31/46 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 451/10 C S P

A 61 K 31/46

A 61 P 11/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年4月21日(2009.4.21)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下からなる群から選択される臭化チオトロピウムの結晶物：

- X線粉末ダイアグラムにおいてd=5.89 であることを特徴とする、結晶性臭化チオトロピウム無水物、
- X線粉末ダイアグラムにおいてd=4.14 であることを特徴とする、結晶性臭化チオトロピウムのメタノール溶媒和物、
- X線粉末ダイアグラムにおいてd=4.15 であることを特徴とする、結晶性臭化チオトロピウムのエタノール溶媒和物、
- X線粉末ダイアグラムにおいてd=4.17 であることを特徴とする、結晶性臭化チオトロピウムのイソプロパノール溶媒和物、
- X線粉末ダイアグラムにおいてd=4.92 であることを特徴とする、結晶性臭化チオトロピウムのTHF溶媒和物、
- X線粉末ダイアグラムにおいてd=4.15 であることを特徴とする、結晶性臭化チオトロピウムの1,4-ジオキサン溶媒和物、
- X線粉末ダイアグラムにおいてd=5.69 であることを特徴とする、結晶性臭化チオトロピウムのジメチルホルムアミド溶媒和物、
- X線粉末ダイアグラムにおいてd=6.56 であることを特徴とする、結晶性臭化チオトロピウムの塩化メチレン/メチルエチルケトン混合溶媒和物、及び
- X線粉末ダイアグラムにおいてd=4.94 であることを特徴とする、結晶性臭化チオトロピウムの1-ブタノール溶媒和物。

【請求項2】

X線粉末ダイアグラムにおいてd=5.89、4.90 及び4.84 であることを特徴とする、請求項1記載の結晶性臭化チオトロピウム無水物。

【請求項3】

X線粉末ダイアグラムにおいてd=4.94、4.50 及び4.14 であることを特徴とする、

請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムのメタノール溶媒和物。

【請求項 4】

X線粉末ダイアグラムにおいてd=4.90、4.46及び4.15であることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムのエタノール溶媒和物。

【請求項 5】

X線粉末ダイアグラムにおいてd=4.91、4.48及び4.17であることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムのイソプロパノール溶媒和物。

【請求項 6】

X線粉末ダイアグラムにおいてd=5.80、4.92及び4.15であることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムのTHF溶媒和物。

【請求項 7】

X線粉末ダイアグラムにおいてd=5.79、4.92及び4.15であることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムの1,4-ジオキサン溶媒和物。

【請求項 8】

X線粉末ダイアグラムにおいてd=5.69、4.94及び4.11であることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムのDMF溶媒和物。

【請求項 9】

X線粉末ダイアグラムにおいてd=6.56、4.22及び4.13であることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムの塩化メチレン/メチルエチルケトン混合溶媒和物。

【請求項 10】

X線粉末ダイアグラムにおいてd=4.94、4.51及び4.17であることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムの1-ブタノール溶媒和物。

【請求項 11】

結晶性臭化チオトロピウムー水和物のジメチルホルムアミド溶液をアセトニトリルに添加し、得られた混合物を20未満に冷却し、できた結晶を単離させることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウム無水物の製造方法。

【請求項 12】

無水臭化チオトロピウムをメタノール含有溶媒から再結晶させることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムのメタノール溶媒和物の製造方法。

【請求項 13】

無水臭化チオトロピウムをエタノール含有溶媒から再結晶させることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムのエタノール溶媒和物の製造方法。

【請求項 14】

結晶性臭化チオトロピウムー水和物のイソプロパノール溶液を20未満に冷却し、できた結晶を単離させることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムのイソプロパノール溶媒和物の製造方法。

【請求項 15】

結晶性臭化チオトロピウムー水和物の好適なアルコール溶液をTHF含有溶液に添加し、できた結晶を単離させることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムのTHF溶媒和物の製造方法。

【請求項 16】

結晶性臭化チオトロピウムー水和物の好適なアルコール溶液を1,4-ジオキサン含有溶液に添加し、できた結晶を単離させることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムの1,4-ジオキサン溶媒和物の製造方法。

【請求項 17】

結晶性臭化チオトロピウムー水和物のDMF溶液をメチルt-ブチルエーテルに添加し、できた結晶を単離させることを特徴とする、請求項 1 記載の結晶性臭化チオトロピウムのDMF溶媒和物の製造方法。

【請求項 18】

結晶性臭化チオトロピウムー水和物の好適なアルコール溶液を、塩化メチレン及びメチルエチルケトンを含む溶媒に添加し、得られた混合物を20℃未満に冷却してもよく、できた結晶を単離させることを特徴とする、請求項1記載の結晶性臭化チオトロピウムの塩化メチレン／メチルエチルケトン混合溶媒和物の製造方法。

【請求項19】

結晶性臭化チオトロピウムー水和物の好適なアルコール溶液を、1-ブタノールを含む溶媒に添加して、得られた混合物を20℃未満、好ましくは10℃未満に冷却してもよく、できた結晶を単離させることを特徴とする、請求項1記載の結晶性臭化チオトロピウムの1-ブタノール溶媒和物の製造方法。

【請求項20】

請求項1～10のいずれか1項記載のチオトロピウムを含有することを特徴とする医薬組成物。

【請求項21】

前記医薬組成物が、請求項1～10のいずれか1項記載のチオトロピウムと共に、ベータ受容体刺激薬(betamimetics)、EGFR阻害剤、PD-EIV-阻害剤、ステロイド類及びLTD4拮抗薬から選択される1種以上の有効成分とを含み、さらに、医薬的に許容される賦形剤と一緒に含んでいてもよい、請求項20記載の医薬組成物。

【請求項22】

請求項1記載のチオトロピウム結晶物を製造するための、出発物質としての結晶性臭化チオトロピウムー水和物の使用。

【請求項23】

請求項1記載のチオトロピウム結晶物を製造するための、出発物質としての結晶性臭化チオトロピウム無水物の使用。